PCT

世界知的所有権機関 原事務局 特許協力条約に基づいて公開された国際出願



(51) 国際特許分類6

C07C 257/18, 279/14, 279/18, 311/16, C07D 295/14, A61K 31/215, 31/24, 31/245, 31/27, 31/40, 31/445

(11) 国際公開番号

WO97/37969

(43) 国際公開日

1997年10月16日(16.10.97)

(21) 国際出願番号

PCT/JP97/01215

(22) 国際出願日

1997年4月9日(09.04.97)

JP

A1

(30) 優先権データ

特顏平8/113159

1996年4月10日(10.04.96)

(81) 指定国 JP, KR, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

添付公開書類

国際調査報告書

(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)

小野薬品工業株式会社

(ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.)[JP/JP]

〒541 大阪府大阪市中央区道修町2丁目1番5号 Osaka, (JP)

(72) 発明者;および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ)

木戸 博(KIDO, Hiroshi)[JP/JP]

〒770 徳島県徳島市東吉野町3丁目11番地の10 Tokushima, (JP)

中井久郎(NAKAI, Hisao)[JP/JP]

〒618 大阪府三島郡島本町桜井3-1-1

小野薬品工業株式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka, (JP)

(74) 代理人

弁理士 大家邦外, 外(OHIE, Kunihisa et al.)

〒103 東京都中央区日本橋人形町2丁目2番6号 堀口第2ビル7

階 大家特許事務所 Tokyo, (JP)

TRYPTASE INHIBITOR AND NOVEL GUANIDINO DERIVATIVES (54) Title:

トリプターゼ阻害剤および新規なグアニジノ誘導体 (54)発明の名称

$$G_{U}$$
 (CH₂), COO (II)

$$H_2N$$
 H_2N
 Gu
 Gu
 Gu
 Gu

(57) Abstract

A tryptase inhibitor comprising as the active ingredient at least one member selected from among guanidinoaliphatic acid derivatives of general formula (I), guanidinobenzoic acid derivatives of general formula (II), guanidinophenol derivatives of general formula (III) and amidinophenol derivatives of general formula (IV); and novel guanidinophenol derivatives of general formula (V) (in the formulae, Gu is guanidino).

(57) 要約

AAAAABBBBBBBBBCCCCCCCCDDE

式(I)のグアニジノ脂肪酸誘導体、式(II)のグアニジノ安息香酸誘導体、式(III)のグアニジノフェノール誘導体、式(IV)のアミジノフェノール誘導体等から選ばれる1種以上を有効成分とするトリプターゼ阻害剤、並びに式(V)の新規なグアニジノフェノール誘導体(式中、Guはグアニジノ基を表す。)。

1

$$\begin{array}{c|c} Gu-(CH_{2})_{1}COO- \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\$$

WO 97/37969

5

ź

PCT/JP97/01215

明細書

トリプターゼ阻害剤および新規なグアニジノ誘導体

技術分野

本発明は、グアニジノ脂肪酸誘導体、グアニジノ安息香酸誘導体、グアニジノフェノール誘導体、アミジノフェノール誘導体およびそれらの非毒性塩、酸付加物塩または水和物から選ばれる1種またはそれ以上の物質を有効成分として含有するトリプターゼ阻害剤および新規なグアニジノフェノール誘導体およびそれらの非毒性塩、酸付加物塩または水和物に関する。さらに詳しく言えば、一般式(I)~(IV)

$$H_2N$$
 N
 N
 COO
 R^1
 (I)

$$H_2N$$
 N
 R^3
 $COOR^2$

$$H_2N$$
 N
 N
 R^5
(III)

$$H_2N$$
 H_0
 R^6
 (IV)